

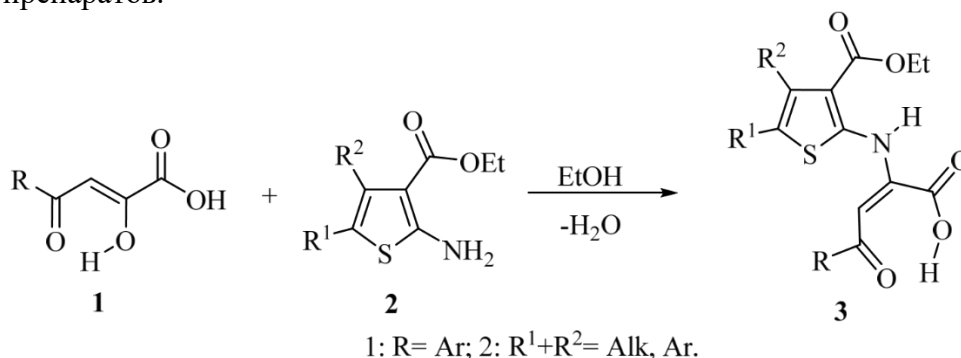
## УД-12

## ПОИСК АНТИМИКРОБНОЙ АКТИВНОСТИ В РЯДУ ЗАМЕЩЕННЫХ 4-АРИЛ-4-ОКСО-2-ТИЕНИЛАМИНОБУТ-2-ЕНОВЫХ КИСЛОТ

С. А. Шипиловских, Р. Р. Махмудов, С. Ю. Баландина, А. Е. Рубцов

Пермский государственный национальный исследовательский университет, 614990,  
Россия, г. Пермь, ул. Букирева, 15.  
E-mail: shipilovskikh@psu.ru

Анализ литературных данных показывает высокий потенциал аминотиофенов Гевальда при построении на их основе биологически активных соединений [1–4]. Ранее нами было продемонстрировано наличие противомикробной активности у 4-арил-2-амино-4-оксобут-2-еновых кислот [5]. В данной работе проведены исследования противомикробной активности в ряду замещенных 4-арил-4-оксо-2-тиениламинобут-2-еновых кислот и обнаружено, что несколько исследуемых веществ обладают выраженной противомикробной активностью, а некоторые находятся на уровне препарата сравнения диоксида. Также проведен анализ острой токсичности для всех полученных соединений и установлено, что они относятся к 5 классу практически нетоксичных препаратов.



Будет обсуждаться антимикробная и потенциальная биологическая активность соединений 3.

## Библиографический список

1. Structure-activity relationship study of novel tissue transglutaminase inhibitors / E. Duval, A. Case, R.L. G.D. Stein, Cuny // Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters. - 2005. Iss. 7. P. 1885-1889.
2. Discovery and investigation of a novel class of thiophene-derived antagonists of the human glucagon receptor / J.L. Duffy, B.A. Kirk, Z. Konteatis, E.L. Campbell, R. Liang, E.J. Brady, M.R. Candelore, V.D. Ding, G. Jiang, F. Liu, S.A. Qureshi, R. Saperstein, D. Szalkowski, S. Tong, Tota L.M., D. Xie, X. Yang, P. Zafian, S. Zheng, K.T. Chapman, B.B. Zhang, and J.R. Tata // Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters. - 2005. Iss. 5. P. 1401-1405.
3. Inhibition of herpes proteases and antiviral activity of 2-substituted thieno[2,3-d]oxazinones / R.L. Jarvest, I.L. Pinto, S.M. Ashman, C.E. Dabrowski, A.V. Fernandez, L.J. Jennings, P. Lavery and D.G. Tew // Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters. - 1999. Iss. 3. P. 443-448.
4. Potent selective thienoxazinone inhibitors of herpes proteases / R.L. Jarvest, S.C. Connor, J.G. Gorniak, L.J. Jennings, H.T. Serafinowska and A. West // Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters. - 1997. Iss. 13. P. 1733-1738.
5. Synthesis and Analgesic Activity of Substituted 4-(Het)aryl-4-oxo-2-thienylaminobut-2-enoic Acids / S.A. Shipilovskikh, R.R. Makhmudov, D.Y. Lupach, P.T. Pavlov, E.V. Babushkina and A.E. Rubtsov // Pharmaceutical Chemistry Journal. - 2013. Iss. 7. P. 366-370.

Работа выполнена при финансовой поддержке РФФИ, проект № 19-43-590023.